

**Use of 1-phenyl pyrazole compounds**

**Use of 1-phenyl pyrazole compounds**

Patent Number: FR2745467  
Publication date: 1997-09-05  
Inventor(s): NGUYEN DANG LONG  
Applicant(s): RHONE POULENC AGROCHIMIE (FR)  
Requested Patent: ☐ FR2745467  
Application Number: FR19960002986 19960304  
Priority Number(s): FR19960002986 19960304  
IPC Classification: A01N43/56  
EC Classification: A01N43/56, A01N47/02  
EC Classification: A01N43/56 ; A01N47/02  
Equivalents:

**Abstract**

The protection of crops, especially rice crops, against viral attack by application of an effective quantity of a 1-phenyl pyrazole (I) is new

(19) RÉPUBLIQUE FRANÇAISE  
INSTITUT NATIONAL  
DE LA PROPRIÉTÉ INDUSTRIELLE  
PARIS

(11) N° d publication :  
(à n'utiliser que pour les  
commandes de reproduction)

2 745 467

(21) N° d'enregistrement national : 96 02986

(51) Int Cl<sup>6</sup> : A 01 N 43/56 // (A 01 N 43/56, 43:40)

DEMANDE DE BREVET D'INVENTION

A1

(12)

(22) Date de dépôt : 04.03.96.

(30) Priorité :

(43) Date de la mise à disposition du public de la  
demande : 05.09.97 Bulletin 97/36.

(56) Liste des documents cités dans le rapport de  
recherche préliminaire : Se reporter à la fin du  
présent fascicule.

(60) Références à d'autres documents nationaux  
apparentés :

(71) Demandeur(s) : RHONE POULENC AGROCHIMIE —  
FR.

(72) Inventeur(s) : NGUYEN DANG LONG.

(73) Titulaire(s) : .

(74) Mandataire :

(54) PYRAZOLES CONTRE LES VIRUS DES PLANTES.

(57) Procédé pour protéger les cultures des attaques vira-  
les caractérisé en ce qu'on applique une quantité efficace  
de 1-phényl pyrazole.

FR 2 745 467 - A1



### Pyrazoles contre les virus des plantes

La présente invention concerne un procédé de traitement des plantes contre  
5 les attaques virales.

Un premier objet de l'invention est de lutter contre les maladies virales de  
manière curative ou préventive.

Un autre objet de la présente invention est de protéger les plantes contre les  
attaques ou maladies virales .

10 Un autre objet de la présente invention est de protéger les cultures de riz  
contre les attaques ou maladies virales .

Un autre objet de la présente invention est de protéger les plantes contre les  
attaques des virus, ces attaques étant éventuellement jointes à des attaques par des  
insectes.

15 Un autre objet de la présente invention est de protéger les plantes, par un  
traitement à l'aide d'un seul produit, à la fois contre les attaques par les virus et par  
les attaques par les insectes ou arthropodes.

Autrement dit encore, un autre objet de la présente invention est de protéger  
les plantes, par un traitement unique, à l'aide d'un seul produit efficace à la fois  
20 contre les attaques par les virus et par les attaques par les insectes ou arthropodes.

Un autre objet de l'invention est de protéger les plantes contre les attaques ou  
maladies virales choisies dans le groupe constitué parmi celles figurant au tableau  
suivant :

N°	terme anglais	terme français
1	Leaf Yellowing of rice	Jaunissement des feuilles pour le riz
2	Orange leaf	
3	grassy stunt	
4	ragged stunt	

25 Il a maintenant été trouvé que ces buts pouvaient être atteints grâce au  
procédé selon l'invention.

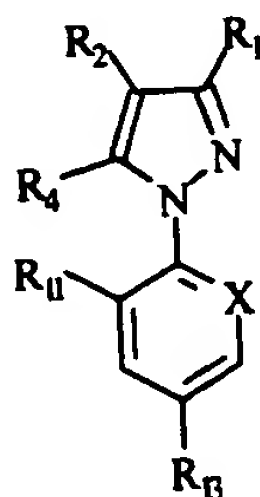
Celle-ci concerne un procédé pour protéger les cultures, et plus spécialement  
les cultures de riz, contre des attaques virales caractérisé en ce qu'on applique une  
quantité efficace de 1-phényl pyrazole.

L'invention concerne encore un procédé selon l'une des revendications précédentes caractérisé en ce qu'il est mis en oeuvre contre les attaques des virus produisant des effets connus en langue anglaise sous les noms de leaf yellowing, orange leaf, grassy stunt, et ragged stunt.

5 Plus précisément l'invention concerne encore un procédé de protection des cultures de riz contre les attaques virales et les attaques par des arthropodes ou insectes, ces deux sortes d'attaques étant simultanées ou pouvant être simultanées ou étant attendues comme pouvant avoir lieu dans une même période de temps.

10 Sur un plan pratique, la protection des cultures conférées par les 1-phényl pyrazoles est généralement meilleure à l'égard des insectes ou arthropodes. Vis-à-vis des attaques virales, la protection conférées par les produits selon l'invention peut ne pas être parfaite, mais elle est en général suffisante, et en tout cas elle constitue un complément très précieux de l'activité insecticide ou arthropodicide pour protéger autant que possible les cultures contre les attaques extérieures les plus diverses.

15 Les 1-phényl pyrazoles susceptibles d'être mis en oeuvre dans l'invention sont avantageusement des produits de formule (I):



(I)

20 dans laquelle :

$R_1$  est CN ou méthyle;

$R_2$  est  $S(O)_n R_3$ ;

25  $R_3$  est alkyl ou haloalkyl;

$R_4$  représente un atome d'hydrogène ou d'halogène; ou un radical  $NR_5 R_6$ ,  $S(O)_m R_7$ ,  $C(O)R_7$ , alkyl, haloalkyl ou  $OR_8$  ou un radical  $-N=C(R_9)(R_{10})$ ;

R<sub>5</sub> et R<sub>6</sub> représentent indépendamment l'atome d'hydrogène ou un radical alkyl, haloalkyl, C(O)alkyl, S(O)<sub>r</sub>CF<sub>3</sub>; ou R<sub>5</sub> et R<sub>6</sub> peuvent former ensemble un radical alkylene divalent qui peut être interrompu par un ou deux hétéroatomes divalents, tels que l'oxygène ou le soufre;

5 R<sub>7</sub> représente un radical alkyl ou haloalkyl;

R<sub>8</sub> représente un radical alkyl, haloalkyl ou un atome d'hydrogène;

R<sub>9</sub> représente un radical alkyl ou un atome d'hydrogène;

10 R<sub>10</sub> représente un groupe phenyl ou heteroaryl éventuellement substitué par un ou plusieurs atomes d'halogène ou groupes tels que OH, -O-alkyl, -S-alkyl, cyano, ou alkyl;

R<sub>11</sub> et R<sub>12</sub> représentent, indépendamment l'un de l'autre, un atome d'hydrogène ou d'halogène;

R<sub>13</sub> représente un atome d'halogène ou un groupe haloalkyl, haloalkoxy, S(O)<sub>q</sub>CF<sub>3</sub> ou SF<sub>5</sub>;

15 m, n, q, r représentent, indépendamment l'un de l'autre, un nombre entier égal à 0, 1 ou 2;

X représente un atome d'azote trivalent ou un radical C-R<sub>12</sub>, les trois autres valences de l'atome de carbone faisant partie du cycle aromatique;

20 sous réserve que, lorsque R<sub>1</sub> est méthyle, alors R<sub>3</sub> est haloalkyl, R<sub>4</sub> est NH<sub>2</sub>, R<sub>11</sub> est Cl, R<sub>13</sub> est CF<sub>3</sub>, et X est N.

Une classe préférée de composés de formule (I) est constituée par les composés tels que R<sub>1</sub> est CN, R<sub>3</sub> est haloalkyl, R<sub>4</sub> est NH<sub>2</sub>, R<sub>11</sub> et R<sub>12</sub> sont indépendamment l'un de l'autre un atome d'halogène, et R<sub>13</sub> est haloalkyl.

25 Un composé de formule (I) tout particulièrement préféré dans l'invention est le

1-[2,6-Cl<sub>2</sub> 4-CF<sub>3</sub> phenyl] 3-CN 4-[SO-CF<sub>3</sub>] 5-NH<sub>2</sub> pyrazole,  
dénommé ci-après composé A.

30 La préparation de composés de formule (I) peut être faite selon l'un ou l'autre des procédés décrits dans les demandes de brevets WO 87/3781, 93/6089, 94/21606 ou européenne 295117, ou tout autre procédé relevant de la compétence de l'homme du métier spécialiste de synthèse chimique.

Des formulations utilisables dans l'invention sont décrites en particulier dans les demandes de brevet WO 87/3781, 93/6089, 94/21606 et dans la demande européenne 295117. Les formulations décrites dans l'art antérieur

peuvent être adaptées pour les rendre encore plus adaptées à leur usage particulier selon les conditions locales, notamment par des adjonctions d'adjuvants appropriés.

Les formulations convenables pour la mise en oeuvre du procédé selon l'invention contiennent de 0.0001 à 95 % en poids de matière active de formule (I). En ce qui concerne les formulations concentrées à usage commercial (pour le stockage, la vente ou le transport), elles contiennent avantageusement de 0,1 à 15 % en poids de matière active. Les compositions telles qu'utilisées par l'applicateur sont généralement des compositions beaucoup plus diluées. En dehors de cette matière active, les compositions selon l'invention contiennent divers supports solides ou liquides, des tensio-actifs et autres adjuvants de natures les plus diverses, mais agronomiquement acceptables.

De manière avantageuse, les 1-arylpirazoles mises en oeuvre dans l'invention peuvent être formulées comme des compositions fluides ou liquides, des poudres mouillables, des microémulsions. De telles formulations comprennent généralement un ou plusieurs supports ou diluants inertes, solide ou liquide, et agronomiquement acceptables dans le cas de l'application à des zones de cultures.

Des formulations de poudres mouillables ou de granulés concentrés peuvent être préparées par broyage d'une 1-arylpirazole de formule (I), avec environ 1% à 20% en poids de tensioactif solide anionique. Un tensioactif anionique convenable est l'ester dioctylique du sel de sodium de l'acide sulfosuccinique. Environ 85% à 95%, en poids, de diluant inerte tel que la montmorillonite, l'attapulгите, la chaux, le talc, le kaolin, la terre de diatomée, la pierre ponce, les silicates ou d'autres produits semblables peuvent être inclus dans de telles formulations, ainsi que les autres adjuvants précédemment indiqués.

Outre les granulés et poudres mouillables décrits ci-dessus, on peut utiliser des formulations fluides, et notamment des formulations facilement dispersables dans l'eau, pour faciliter la dispersion sur le lieu d'application, notamment en agriculture.

Les pyrazoles utilisées dans la présente invention ont une faible solubilité, mais peuvent être utilisées à faibles doses. On peut donc les mettre en oeuvre en

solutions ou émulsions ou, de préférence, sous forme de suspensions aqueuses ou non, comprenant les adjuvants et/ou co-solvants appropriés. L'acétone et la méthyl éthyl cétone peuvent être utilisées comme co-solvants. Tout milieu liquide peut être utilisé pourvu qu'il ne soit ni toxique pour les plantes ni pour l'environnement.

- 5 Quand la matière active est peu soluble, on peut utiliser des co-solvants et/ou des agents mouillants ou dispersants. D'autres additifs peuvent aussi être mis en oeuvre, tels que le talc. Les matières actives de formule (I) peuvent être absorbées sur des supports, par exemple la vermiculite, l'argile, le talc le kaolin ou autres, notamment pour faire des granulés.

- 10 Les 1-arylpirazoles de l'invention peuvent être mises en oeuvre en traitement foliaire, ou en traitement du sol ou, de préférence, en traitement de semences. La quantité précise de phényl pyrazole mise en oeuvre peut être déterminée par un petit nombre d'expérimentation. La quantité ne doit pas être phytotoxique.

- Sur un plan pratique, les doses appliquées soit directement par le feuillage ou par le sol, soit par le moyen des semences traitées, sont  
15 généralement comprises entre 5 et 500 g/ha, de préférence entre 10 et 200 g/ha, et encore plus préférentiellement entre 20 et 80 g/ha. La dose appliquée à la semence dépend de la quantité de semence semée, et l'on admet que, lors du premier semis aussi bien que lors du second semis, les  
20 quantités de semences semées sont du même ordre de grandeur. Une fois la semence semée, la dose amenée au sol par le moyen des grains traités correspond à ce qui vient d'être indiqué. Dans le cas du riz, les quantités de semences semées sont de l'ordre de 0,5 à 3 quintal par ha.

- Les semences peuvent être traitées par revêtement, enduction, imprégnation ou trempage dans des formulations liquides ou pâteuses. De  
25 telles formulations sont connues en soi. On procède en général ultérieurement à un séchage. Des semences traitées comprenant le plus souvent environ 2 à 200 g par quintal de semences, de préférence de 5 à 80 g/q.

- 30 Les exemples suivants, donnés à titre non limitatifs, illustrent l'invention et montrent comment elle peut être mise en oeuvre.

#### Exemple 1:



On a traité des semences de riz à raison de 40 g. de matière active par hectare. Les semences ont été semées à raison de 150 kg/ha sur un terrain sec, et les graines ont été recouvertes d'une fine couche de terre.

On a laissé germer ces grains semés. Au bout de quelques semaines où la température était comprise entre 25°C et 35°C, le sol a été recouvert d'eau par le moyen des pluies et on a observé les résultats au bout de 2 mois. On a répété les essais sur 20 parcelles de 10 m<sup>2</sup> chacune (récolte au bout de 105 jours environ).

On a obtenu les résultats indiqués au Tableau 1 (généralement exprimés en pourcentage) mesurés (sauf indication contraire, par appréciation visuelle) par rapport au témoin constitué par des parcelles de terrain cultivé semblables et traitées à l'aide d'insecticides habituels (en pratique le carbofuran ou les pyréthroides) aux doses normalement actives.

#### Exemple 2:

On répète l'exemple 1 mais en semant les semences à raison de 200 kg/ha. On a obtenu les résultats indiqués au Tableau 1.

#### Exemple 3:

On répète l'exemple 1 mais en effectuant une pré-germination de la semence de riz.

On a obtenu les résultats indiqués au Tableau 1.

20

#### Exemple 4:

On répète l'exemple 2 mais en effectuant une pré-germination de la semence de riz.

On a obtenu les résultats indiqués au Tableau 1.

**Tableau 1:**

Attaque de type N°	Propriété observée pour déterminer le résultat	Résultat observé exprimé en pourcentage			
		Ex.1	Ex.2	Ex.3	Ex.4
1	Nombre de feuilles jaunies	60	66	60	66
2	nombre de rejets qui deviennent orange, puis meurent	77	85	77	85

25



**Revendications :**

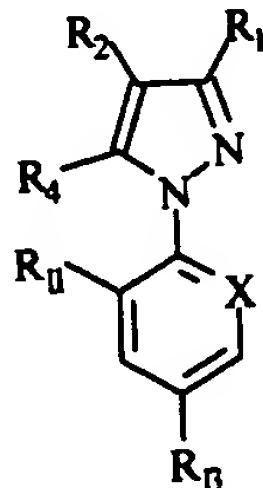
5 1. Procédé pour protéger les cultures contre des attaques virales caractérisé en ce qu'on applique une quantité efficace de 1-phényl pyrazole.

2. Procédé selon la revendication 1 mise en oeuvre pour la protection des cultures de riz.

10 3. Procédé selon l'une des revendications précédentes caractérisé en ce qu'il est mis en oeuvre pour une protection à la fois contre les attaques virales et contre les attaques par des arthropodes ou insectes.

4. Procédé selon l'une des revendications précédentes caractérisé en ce qu'il est mis en oeuvre contre les attaques de virus produisant des effets connus en  
15 langue anglaise sous les noms de leaf yellowing, orange leaf, grassy stunt, et ragged stunt.

5. Procédé selon la revendication 1 caractérisé en ce que le 1-phényl pyrazole a la formule (I)



(I)

dans laquelle :

R<sub>1</sub> est CN ou méthyle;

25 R<sub>2</sub> est S(O)<sub>n</sub>R<sub>3</sub>;

R<sub>3</sub> est alkyl ou haloalkyl;

R<sub>4</sub> représente un atome d'hydrogène ou d'halogène; ou un radical NR<sub>5</sub>R<sub>6</sub>,  
S(O)<sub>m</sub>R<sub>7</sub>, C(O)R<sub>7</sub>, alkyl, haloalkyl ou OR<sub>8</sub> ou un radical -N=C(R<sub>9</sub>)(R<sub>10</sub>);

R<sub>5</sub> et R<sub>6</sub> représentent indépendamment l'atome d'hydrogène ou un radical alkyl, haloalkyl, C(O)alkyl, S(O)<sub>r</sub>CF<sub>3</sub>; ou R<sub>5</sub> et R<sub>6</sub> peuvent former ensemble un radical alkylene divalent qui peut être interrompu par un ou deux hétéroatomes divalents, tels que l'oxygène ou le soufre;

5 R<sub>7</sub> représente un radical alkyl ou haloalkyl;

R<sub>8</sub> représente un radical alkyl, haloalkyl ou un atome d'hydrogène;

R<sub>9</sub> représente un radical alkyl ou un atome d'hydrogène;

R<sub>10</sub> représente un groupe phenyl ou heteroaryl éventuellement substitué par un ou plusieurs atomes d'halogène ou groupes tels que OH, -O-alkyl, -S-alkyl, cyano, ou alkyl;

10 R<sub>11</sub> et R<sub>12</sub> représentent, indépendamment l'un de l'autre, un atome d'hydrogène ou d'halogène;

R<sub>13</sub> représente un atome d'halogène ou un groupe haloalkyl, haloalkoxy, S(O)<sub>q</sub>CF<sub>3</sub> ou SF<sub>5</sub>;

15 m, n, q, r représentent, indépendamment l'un de l'autre, un nombre entier égal à 0, 1 ou 2;

X représente un atome d'azote trivalent ou un radical >C-R<sub>12</sub>;

sous réserve que, lorsque R<sub>1</sub> est méthyle, alors R<sub>3</sub> est haloalkyl, R<sub>4</sub> est NH<sub>2</sub>, R<sub>11</sub> est Cl, R<sub>13</sub> est CF<sub>3</sub>, et X est N.

20

6. Procédé selon l'une des revendications précédentes caractérisé en ce que le 1-phényl pyrazole a la formule (I) dans laquelle R<sub>1</sub> est CN, R<sub>3</sub> est haloalkyl, R<sub>4</sub> est NH<sub>2</sub>, R<sub>11</sub> et R<sub>12</sub> sont indépendamment l'un de l'autre un atome d'halogène, et R<sub>13</sub> est haloalkyl.

25

7. Procédé selon l'une des revendications précédentes caractérisé en ce que le 1-phényl pyrazole est le

1-[2,6-Cl<sub>2</sub> 4-CF<sub>3</sub> phenyl] 3-CN 4-[SO-CF<sub>3</sub>] 5-NH<sub>2</sub> pyrazole.

8. Procédé selon l'une des revendications précédentes caractérisé en ce que le traitement est effectué sur le feuillage ou sur le sol ou sur les semences.

30

9. Procédé selon la revendication 1 caractérisé en ce que le traitement est effectué à raison d'une quantité de composé de formule (I) comprise entre 5 et 500 g/ha, de préférence entre 10 et 200 g/ha.

10. Procédé selon l'une des revendications précédentes caractérisé en ce que le 1-phényl pyrazole est appliqué à des doses comprises entre 20 et 80 g/ha.

5 11. Procédé selon l'une des revendications précédentes caractérisé en ce que le 1-phényl pyrazole est appliqué en traitement de semences à raison de 2 à 200 g. par quintal de semences, de préférence de 5 à 80 g/q.

12. Procédé selon l'une des revendications précédentes caractérisé en ce que le 1-phényl pyrazole est appliqué en traitement de semences à raison de 5 à 60 g. par quintal de semences

10 13. Compositions pour la mise en oeuvre d'un procédé selon l'une des revendications précédentes caractérisées en ce qu'elles contiennent de 0.0001 à 95 % en poids de matière active de formule (I).

DOCUMENTS CONSIDERES COMME PERTINENTS		Revendications concernées de la demande examinée
Catégorie	Citation du document avec indication, en cas de besoin, des parties pertinentes	
D,X	EP-A-0 295 117 (MAY & BAKER LTD) 14 Décembre 1988	13
A	* le document en entier *	1-12
	---	
X	EP-A-0 500 209 (RHONE POULENC AGROCHIMIE) 26 Août 1992	13
A	* le document en entier *	1-12
	---	
X	FR-A-2 696 906 (RHONE POULENC AGROCHIMIE) 22 Avril 1994	13
A	* le document en entier *	1-12
	---	
A	US-A-3 592 890 (JANIAK MARIAN) 13 Juillet 1971	1-13
	* le document en entier *	
	---	
A	DATABASE WPI Section Ch, Week 7425 Derwent Publications Ltd., London, GB; Class B03, AN 74-46077V XP002018412 & JP-A-49 043 986 (CHUGAI PHARM CO) , 25 Avril 1974 * abrégé *	1-13
	-----	
Date d'achèvement de la recherche		Examineur
13 Novembre 1996		Lamers, W
CATEGORIE DES DOCUMENTS CITES		
X : particulièrement pertinent à lui seul		
Y : particulièrement pertinent en combinaison avec un autre document de la même catégorie		
A : pertinent à l'encontre d'au moins une revendication ou arrière-plan technologique général		
O : divulgation non-écrite		
P : document intercalaire		
T : théorie ou principe à la base de l'invention		
E : document de brevet bénéficiant d'une date antérieure à la date de dépôt et qui n'a été publié qu'à cette date de dépôt ou qu'à une date postérieure.		
D : cité dans la demande		
L : cité pour d'autres raisons		
A : membre de la même famille, document correspondant		